



Xylestesin® 10%

lidocaína base

FORMA FARMACÊUTICA E DE APRESENTAÇÃO:

Solução Tópica Spray
Frasco nebulizador com 50 ml

USO PEDIÁTRICO E ADULTO

COMPOSIÇÃO:

Cada ml da solução contém:

lidocaína base	100 mg
veículo q.s.p	1 ml
(Veículo: sacarina sódica, edetato dissódico, propilenoglicol, aroma cereja/menta, álcool etílico, água purificada)	

INFORMAÇÕES E PACIENTE:

O produto é indicado como anestésico tópico para uso na cavidade oral.
O produto deve ser conservado em temperatura ambiente, entre 15 e 30°C, protegido da luz.
O prazo de validade do produto é de 36 meses, a partir da data de fabricação impressa na embalagem. Não utilize medicamento vencido, pois pode ser prejudicial à saúde.
Informe seu médico sobre a ocorrência de gravidez na vigência do tratamento ou após o seu término. Informar ao médico se está amamentando.
Para utilizar a solução spray, basta orientar a cânula para a região a ser anestesiada e imprimir uma leve pressão sobre o botão.
Aconselha-se após o uso, retirar o botão com a cânula e conservá-los em solução alcoólica, de modo a evitar uma possível deposição de cristais.

Siga a orientação do seu médico, respeitando sempre os horários, as doses e a duração do tratamento.
Não interromper o tratamento sem o conhecimento do seu médico.
Tanto a administração como a suspensão do tratamento somente deverão ser feitas sob orientação de seu médico.
Informe seu médico sobre o aparecimento de reações desagradáveis. Raramente ocorrem reações alérgicas, nervosismo, tontura, queda de pressão, batimento mais lento do coração. Caso ocorram estas reações, informar imediatamente ao médico.

TODO MEDICAMENTO DEVE SER MANTIDO FORA DO ALCANCE DAS CRIANÇAS.

Quando os anestésicos tópicos são utilizados na boca, o paciente deve estar ciente que a produção de anestesia local pode prejudicar a deglutição e, desta forma, aumentar o perigo de aspiração, ou seja, o alimento ir para os pulmões. Por esta razão, alimentos não devem ser ingeridos nos 60 minutos seguidos do uso de preparações anestésicas na boca e na região da garganta. Isto é particularmente importante em crianças, por causa da frequência de alimentação.
O produto está contra-indicado a pacientes com conhecida hipersensibilidade a anestésicos locais do tipo amida (como a lidocaína) ou aos outros componentes da fórmula. Não deve ser aplicado na laringe. Seu uso não é recomendado a crianças menores de 5 anos ou com menos de 20 kg de peso.
A lidocaína solução tópica spray, deve ser usada com cuidado em pacientes com epilepsia, falha na condução cardíaca, batimento lento do coração, problema grave de fígado, com ferimentos ou infecção no local da aplicação ou em pacientes tratados com medicamentos antiarrítmicos.

A dormência da língua e da boca pode aumentar o risco de machucados por mordida. Evite contato com os olhos.
Informe seu médico sobre qualquer medicamento que esteja usando, antes do início ou durante o tratamento.
A lidocaína somente deve ser administrada durante a gravidez ou amamentação quando os benefícios justificarem os riscos.

NÃO TOME REMÉDIO SEM O CONHECIMENTO DO SEU MÉDICO, PODE SER PERIGOSO PARA SUA SAÚDE.

INFORMAÇÕES TÉCNICAS:

CARACTERÍSTICAS

Xylestesin® Spray 10% contém o agente anestésico lidocaína e está indicado para ser administrado topicamente na cavidade oral.
A lidocaína é um anestésico de superfície, possuindo grande poder de penetração nos tecidos e grande margem de segurança.
A lidocaína estabiliza a membrana neuronal pela inibição dos fluxos iônicos necessários para o início e a condução dos impulsos, assim efetuando a ação anestésica local.
A anestesia ocorre normalmente dentro de 1 a 2 minutos e persiste por aproximadamente 10 a 15 minutos.

O excessivo nível sanguíneo pode causar alterações no débito cardíaco, na resistência total periférica e na pressão arterial média. Estas alterações podem ser atribuídas ao efeito depressor direto do agente anestésico local sobre os vários componentes do sistema cardiovascular.
A lidocaína pode ser absorvida logo após a aplicação tópica na membrana mucosa, e seu grau de absorção e porcentagem da dose absorvida dependem da dose total e da concentração administrada, do local da aplicação e do tempo de exposição ao anestésico.
Geralmente, o grau de absorção do anestésico local logo após a aplicação ocorre mais rapidamente após a aplicação endotraqueal. A lidocaína é absorvida no trato gastrointestinal, mas pouca droga intacta aparece na circulação por causa da biotransformação no fígado, onde é metabolizada rapidamente. Os metabólitos intactos da droga são excretados pelos rins.
A biotransformação inclui N-dealquilação oxidativa, anel de hidroxilação, clivagem da linhagem amida e conjugação. A N-dealquilação é a maior via de biotransformação, produzindo os metabólitos monoetilglicinaxilidida e glicinaxilidida. As ações farmacológicas e toxicológicas destes metabólitos são similares mas menos potentes em relação à lidocaína. Aproximadamente 90% da lidocaína administrada é excretada na forma de vários metabólitos e menos de 10% é excretada inalterada. O metabólito primário encontrado na urina é o conjugado de 4-hidroxi-2,6-dimetilanilina.
A ligação plasmática da lidocaína é dependente da concentração, e a fração ligada diminui com o aumento da concentração.
Em concentrações de 1 a 4 mg de base livre por ml, de 60% a 80% de lidocaína é ligação protéica. A ligação também depende da concentração plasmática e da glicoproteína alfa-1-ácido.
A lidocaína atravessa a barreira hematoencefálica e a barreira placentária, presumivelmente por difusão passiva.
Estudos do metabolismo da lidocaína após injeção de bolus intravenoso, mostram que a meia vida do produto (eliminação) é de 1,5 a 2,0 horas.
Devido a essa rápida velocidade com a qual é metabolizada, qualquer condição que afete o funcionamento do fígado pode alterar a cinética da lidocaína. A meia vida pode ser dobrada em pacientes com disfunções hepáticas. A disfunção renal não afeta a cinética da lidocaína, mas pode aumentar a concentração de metabólitos. Fatores como acidose e o uso de estimulantes e depressores do SNC, afetam os níveis de lidocaína no SNC produzindo reações sistêmicas.
As objetivas manifestações adversas começam a aumentar aparentemente com o aumento do nível plasmático venoso, acima de 6,0 mg de base livre por ml.

INDICAÇÕES:

Otorrinolaringologia:

- Punções dos seios maxilares
- Paracentese do tímpano
- Anestesia da orofaringe para prevenir náuseas e vômitos durante instrumentação

Obstetrícia:

- Durante o estágio final do parto e antes da episiotomia e sutura perineal como adjuvante no controle da dor.

Odontologia:

- Antes de injeções
- Impressões dentárias
- Radiografias
- Remoção de tártaro

CONTRA-INDICAÇÕES:

Xylestesin® Spray 10% está contra-indicada em pacientes com história de hipersensibilidade a anestésicos locais do tipo amida ou a outros componentes da fórmula.
O uso do produto não é recomendado em crianças menores de 5 anos ou com menos de 20 kg de peso, em vista da concentração elevada (10%) e de sua rápida absorção.

PRECAUÇÕES:

De modo a poder controlar possíveis reações adversas, equipamento de ressuscitação, oxigênio e outras drogas afins, deverão estar disponíveis quando os anestésicos locais do tipo amida forem administrados em membranas mucosas.
Xylestesin® Spray 10% deverá ser utilizada com extremo cuidado se houver infecção ou se a área da aplicação estiver traumatizada, pois sob tais condições, há uma rápida absorção sistêmica.
Deve ser usada a mais baixa dosagem que resulte em anestesia efetiva, para evitar altos níveis séricos e efeitos adversos.
A segurança e eficácia da lidocaína dependem da dose correta, da técnica, precauções adequadas e rapidez nas emergências. Repetidas doses de lidocaína podem causar significativo aumento dos níveis sanguíneos devido à lenta acumulação da droga e seus metabólitos. A tolerância varia de acordo com o estado do paciente.
Pacientes idosos e debilitados, doentes graves e crianças, deverão ter doses reduzidas de acordo com a idade e estado físico.
A lidocaína deve ser usada com cuidado em paciente em choque grave ou bloqueio cardíaco. Também deve-se ter cuidado com pacientes com conhecida sensibilidade a drogas. Pacientes alérgicos à derivados do ácido para-aminobenzoico, como procaina, tetracaína e benzocaína, não têm apresentado sensibilidade cruzada à lidocaína.

Medida = **Altura (150 mm) x Comprimento (300 mm)**

FIBRA

Muitas drogas usadas durante a anestesia são consideradas um potencial agente desencadeador da hipertermia maligna. Não é conhecido se anestésicos locais do tipo amida podem desencadear esta reação e a necessidade de uma anestesia geral suplementar pode não ser um prognóstico progressivo para o desencadeamento desta reação. Sugere-se que o protocolo padrão para controle destas reações esteja sempre disponível. Os sinais prematuros como taquicardia, taquipnéia, variações da pressão sanguínea e acidose metabólica, podem ser um precedente de elevação de temperatura.

Resultados bem sucedidos dependem de um diagnóstico prematuro da pronta descontinuação do agente suspeito de desencadeamento da reação e instituição de tratamento, incluindo terapia com oxigênio, medidas de suporte adequadas e dantroleno sódico (consultar a bula do produto antes do uso).

A absorção através das mucosas e superfícies feridas é relativamente alta, especialmente na laringe e árvore brônquica.

Deve ser usada com cautela em pacientes com epilepsia, falha na condução cardíaca, bradicardia, disfunção hepática e choque grave, se a dose ou local de administração propiciarem altos níveis sanguíneos. A anestesia tópica da orofaringe pode interferir com a deglutição e causar perigo de aspiração. Isto é particularmente importante em crianças, devido à frequência da alimentação. A dormência da língua e da mucosa bucal pode aumentar o risco de trauma por mordida. Evitar o contato com os olhos.

Gravidez e Amamentação:

Gravidez: Categoria B - A lidocaína atravessa a barreira placentária, podendo penetrar nos tecidos fetais. A lidocaína tem sido administrada a um grande número de mulheres grávidas ou que possam vir a engravidar. Não têm sido relatados distúrbios específicos no processo de reprodução, como aumento de incidência de malformações ou outros efeitos maléficos diretos ou indiretos no feto.

Não se sabe se a lidocaína é excretada no leite materno. Como qualquer outra droga, a lidocaína somente deve ser utilizada durante a gravidez ou amamentação se, a critério médico, os benefícios potenciais superarem os possíveis riscos.

INTERAÇÕES MEDICAMENTOSAS:

A administração concomitante de depressores centrais pode causar efeito aditivo na depressão do SNC. O uso associado a antiarrítmicos, como a tocainida, pode aumentar os efeitos tóxicos da lidocaína. Anticonvulsivos hidantoínicos aumentam os efeitos depressores cardíacos. Bloqueadores beta-adrenérgicos podem diminuir o metabolismo hepático, aumentando a toxicidade da lidocaína. A administração simultânea de cimetidina pode provocar diminuição da depuração hepática da lidocaína. A metoxamina prolonga a restrição da circulação e pode causar necrose. A inibição da transmissão neuronal por anestésicos locais pode antagonizar os efeitos dos antiastênicos sobre o músculo esquelético, especialmente se grandes quantidades de anestésicos são rapidamente absorvidas; pode ser necessário o ajuste temporário da dose dos antiastênicos no controle da miastenia gravis. A inibição da transmissão neuronal por anestésicos locais pode aumentar ou prolongar a ação de agentes bloqueadores neuromusculares se grandes quantidades do anestésico forem rapidamente absorvidas.

REAÇÕES ADVERSAS E ALTERAÇÃO EM EXAMES LABORATORIAIS:

Reações adversas são geralmente relacionadas com a dose de anestésicos locais e resultam de altos níveis plasmáticos causados por dosagem excessiva ou rápida absorção, bem como por tolerância reduzida do paciente, idiossincrasia ou hipersensibilidade. As reações sistêmicas podem ocorrer rapidamente ou até 30 minutos após administração. Acidose acentuada ou hipóxia podem aumentar o risco e a gravidade das reações tóxicas. São raras as reações adversas à lidocaína nas doses recomendadas. As seguintes reações adversas foram observadas com todas as vias de administração e não foram necessariamente relatadas durante seu uso tópico.

-Reações Alérgicas: São extremamente raros os casos de reações alérgicas associadas a anestésicos locais do tipo amida, sendo que nos casos mais graves pode ocorrer choque anafilático. Podem ocorrer rash cutâneo, eritema, urticária, prurido, espirros, edema urticariforme na face, lábios, língua, boca ou garganta, que podem ser acompanhados por náusea com ou sem vômito. O valor dos testes cutâneos para determinação de sensibilidade é duvidoso.

-Sistema Cardiovascular: As manifestações cardiovasculares são normalmente depressoras e caracterizadas por vasodilatação periférica, bradicardia, hipotensão, depressão do miocárdio, diminuição do débito cardíaco, arritmias ventriculares e colapso cardiovascular que podem levar a parada cardíaca. A hipóxia causada por convulsões e apnéia pode ser um fator contribuinte nas reações cardiovasculares.

-Sistema Nervoso Central: São manifestações excitatórias e/ou depressivas caracterizadas por delírio, nervosismo, apreensão, euforia, confusão, tontura, sonolência, tinido, visão turva, vômito, sensações de calor e frio, tremores, contorções, convulsões, inconsciência, depressão respiratória e colapso. As manifestações excitatórias podem ser muito breves ou podem simplesmente não ocorrer. Em alguns pacientes, especialmente crianças, a primeira manifestação de toxicidade pode ser uma sonolência, progredindo para inconsciência e parada respiratória.

-Metemoglobinemia: pode ocorrer muito raramente com anestésicos locais, porém é mais provável quando o anestésico é a prilocaína.

Interferência em Exames Laboratoriais

Determinação da função pancreática usando bentiromida: a administração de lidocaína 3 dias antes deste teste pode invalidar seu resultado, devido ao aumento aparente do PABA.

POSOLOGIA:

Como para qualquer anestésico local, as reações e complicações são evitadas utilizando-se a mínima dose eficaz. Nos pacientes idosos ou debilitados e nas crianças, deve-se adequar as doses com a idade e as condições físicas. Cada nebulização libera 10 mg de lidocaína base. É desnecessário secar o local antes da aplicação.

Em adulto, não se deve fazer mais de 20 nebulizações para se alcançar a anestesia desejada.

O número de nebulizações depende da extensão da área a ser anestesiada:

Odontologia: 1 a 5 aplicações.

Otorrinolaringologia: 3 aplicações para punção da cavidade maxilar.

Durante o parto: até 20 aplicações.

Durante instrumentação: até 20 aplicações (200 mg de lidocaína base).

Modo de Usar:

Para utilizar a solução spray, basta orientar a cânula para a região a ser anestesiada e imprimir uma leve pressão sobre o botão.

Aconselha-se, após o uso, retirar o botão com a cânula e conservá-los em solução alcoólica, de modo a evitar uma possível deposição de cristais.

SUPERDOSAGEM:

Emergências graves conseqüentes aos anestésicos locais geralmente estão relacionadas com altos níveis plasmáticos do anestésico.

A primeira consideração é preventiva, com cuidadoso acompanhamento de sinais vitais respiratórios e cardiovasculares e do estado de consciência do paciente após cada administração de anestésico.

O tratamento de um paciente com manifestações tóxicas consiste em assegurar adequada ventilação e evitar convulsões. A ventilação deverá ser mantida com oxigênio através de respiração assistida ou controlada. Se ocorrer convulsão, esta deverá ser rapidamente tratada com administração intravenosa de 50 a 100 mg de succinilcolina e/ou de 5 a 15 mg de diazepam. Como a succinilcolina causa depressão respiratória, esta deverá ser utilizada por médico com habilidade em realizar intubação endotraqueal e de controlar um paciente totalmente paralisado. Também poderá ser utilizada tiopentona, na dose de 100 a 200 mg, para cessar as convulsões. Se ocorrer fibrilação ventricular ou parada cardíaca, deve-se realizar manobras efetivas de reanimação. Deve-se administrar epinefrina em doses repetidas e bicarbonato de sódio o mais rápido possível.

O médico deverá estar familiarizado com o uso de anestésicos e drogas anticonvulsivantes. Se não forem tratadas imediatamente, tanto as convulsões como a depressão cardiovascular podem resultar em hipóxia, acidose, bradicardia, arritmia e parada cardíaca.

A diálise é de insignificante valor no tratamento de superdosagem aguda com lidocaína.

A DL₅₀ intravenosa de cloridrato de lidocaína em camundongos fêmeas é de 26 (21-31) mg/kg e a DL₅₀ subcutânea é de 264 (203-304) mg/kg.

PACIENTES IDOSOS

Pacientes idosos são, em geral, mais sensíveis aos efeitos tóxicos sistêmicos. O uso nesses pacientes deverá ser cauteloso e as doses deverão ser reduzidas.

VENDA SOB PRESCRIÇÃO MÉDICA

Nº do Lote, Data de Fabricação e Prazo de Validade: Vide Rótulo/Cartucho

MS nº 1.0298.0357

Farm. Resp.: Dr. Joaquim A. dos Reis - CRF-SP nº 5061

SAC (Serviço de Atendimento ao Cliente): **0800 701 19 18**



Rod. Itapira-Lindóia, km 14 – Itapira - SP – CNPJ nº 44.734.671/0001-51 – Indústria Brasileira

Cód. 22.1159 - VI/07

Medida = **Altura (150 mm) x Comprimento (300 mm)**

FIBRA